

⑫ 公開特許公報(A) 平4-36212

⑤ Int.Cl.⁵A 61 K 7/00
7/075
9/06

識別記号

F 9051-4C
7038-4C
G 7624-4C※

庁内整理番号

④ 公開 平成4年(1992)2月6日

審査請求 未請求 請求項の数 1 (全9頁)

⑥ 発明の名称 皮膚外用剤

⑦ 特 願 平2-142845

⑧ 出 願 平2(1990)5月31日

⑨ 発 明 者 古 賀 邦 正 東京都千代田区麴町5-7-2 第31森ビルサントリー株式会社内

⑩ 発 明 者 小 林 巧 東京都千代田区麴町5-7-2 第31森ビルサントリー株式会社内

⑪ 発 明 者 藤 川 茂 昭 大阪府三島郡島本町大字山崎1023-1 サントリー株式会社技術開発センター内

⑫ 発 明 者 岡 崎 昌 子 大阪府三島郡島本町大字山崎1023-1 サントリー株式会社技術開発センター内

⑬ 出 願 人 サントリー株式会社 大阪府大阪市北区堂島浜2丁目1番40号

⑭ 代 理 人 弁理士 湯 浅 恭 三 外4名

最終頁に続く

明 細 書

1. [発明の名称]

皮膚外用剤

2. [特許請求の範囲]

キシロビオースを含有する皮膚外用剤。

3. [発明の詳細な説明]

産業上の利用分野

本発明は肌荒れを改善し、皮膚に潤いと輝きを与え、毛髪のバサつきを改善し、しっとり感を与える効果に優れた皮膚外用剤に関する。

従来の技術

化粧品等の皮膚外用剤を使用する大きな目的のひとつに肌荒れ防止、改善がある。この目的を達成するために、従来から各種保湿剤を配合することが行われてきた。しかし、従来から保湿剤として用いられてきた、例えば多糖類はアルコール系の処方では沈殿が生じやすいし、多価アルコールやコンドロイチン硫酸等は多量に配合するとべとついたり、ほてり感があり、又、DL-アラニン

等のアミノ酸では、着色や変臭を生じる場合があり、いまだ充分ではなかった。

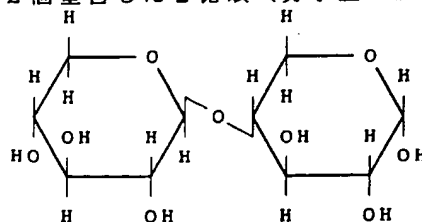
発明が解決しようとする課題

本発明者らは、このような事情に鑑み、保存安定性が良好で、保湿効果に優れ、べたつき、着色、変臭のない皮膚外用剤を得るべく鋭意研究を重ねた結果、キシロビオースを含有する皮膚外用剤を見出し、本発明を完成するに至った。

課題を解決するための手段

本発明は、キシロビオースを配合することにより、これまで問題になっていた種々の問題を解決した、優れた皮膚外用剤を提供するものである。

本発明に用いられるキシロビオースは、下記のごとくペントースであるキシロースが β -1,4結合で2個重合した2糖類(分子量:282)である。



構成糖であるキシロースは、植物中の多糖であるキシランの構成糖であり、ながく食用に供されているノンカロリーの糖である。キシランは、近年、植物繊維として食用としてその有用性が認められているヘミセルロースの一種であり、綿の実、とうもろこし、麦芽及びサトウキビ等の繊維質部分に多く分布していることが知られている。

一方、キシロビオースは、自然界ではタケノコの中に極微量、遊離の状態で存在していることが知られている。

セルロースやヘミセルロース等の植物由来の繊維は、食品や化粧品の素材として用いられており、われわれは、繊維性多糖の糖鎖が短くなったオリゴ糖に着目した。そこで、自然界に極微量しか存在しないキシロビオースについて、その効率的な製造法を開発した（特開昭62-155095、特開昭61-242592、特願昭63-253616）。本発明者等はキシロビオースが皮膚外用剤成分として有用であり、製品に保湿特性を与え、べたつき感がなく、安定で着色したり異臭を生じることがないという

に対して乾燥固形物としてのキシロビオースを通常0.0001~20重量%、好ましくは0.1~10重量%の範囲で配合できる。

本発明で用いるキシロビオースは、キシランをキシロビオース生成酵素により糖化したキシロビオース組成物として使用することもできる。このキシロビオース組成物中にはキシロビオース以外のキシラン糖化物、例えばキシロース、キシロトリオース等が含まれている。これらはキシロビオースの保湿効果を損うものではないが、該組成物中のキシロビオース含有量は20%（重量%、以下同様）以上であることが好ましく、特に50%以上であることが好ましい。

キシロビオースを配合できる本発明の皮膚外用剤としては公知の構成成分を普通に用いられる量で使用できる。

本発明を適用できる皮膚外用剤に用いることのできる成分を、化粧品を例にとって以下に説明する。

本発明を適用できる化粧品に使用できる基剤と

優れた特性を見出した。

本発明においてキシロビオースの配合により優れた効果が得られる皮膚外用剤とは化粧品、医薬品、医薬部外品等に該当する皮膚又は毛髪等に適用又は使用される製品を包含する。それらの剤型としては、水溶液系、可溶化系、乳化系、水/油二層系等の幅広い形態をとることができる。これらの具体例としては、モイスチャークリーム、ローション、乳液、パック、リップトリートメント等の化粧品；軟膏、パップ剤等の医薬品又は医薬部外品；ヘアトリートメント、リンス、整髪剤等のヘアーケア製品；シャンプー、ボディーシャンプーのような洗剤等が含まれる。

本発明におけるキシロビオースの配合量はその効果と経済性によって決定される。キシロビオースは人体に毒性を有しないから、毒性の面からはどのような量で配合することもできるが、少なくとも所期の効果を達成できる濃度であること、及びある程度以上に濃度を増しても効果の増大を期待できないことを考慮すれば、皮膚外用剤全量

としては化粧料の成分として通常配合されている任意のもの、例えば、アーモンド油、アボカード油、オリーブ油、タートル油、ミツロウ、スクワレン、ラノリン、ヒマシ油等の動植物性原料、流動パラフィン、セレシン、パラフィンロウ、ミクロクリスタルロウ、ワセリン、キャンドリラロウ、カルバナロウ、モクロウ等の鉱物性原料、パルミチン酸、ステアリン酸等の脂肪酸類、エタノール等のアルコール類、セタノール、ステアリルアルコール、ラノリンアルコール、オクチルドデカノール、ポリビニルアルコール等の高級アルコール類、イソプロピル・ミリステート、ブチル・ステアレート、アセトグリセリド、アセチル化ラノリン、グリセリンモノステアレート、ポリオキシエチレンモノオレイン酸エステル、ポリエチレングリコールモノステアリン酸エステル、モノオレイン酸エチルエステル等のエステル類、トリエタノールアミンのようなアミン類、ポリオキシエチレンセチルエーテル等のエーテル類、シリコン油等がある。

これら基剤のほかにスパン、ツィーン、砂糖糖エ

ステル又は多価アルコールエステル類の如き種々の界面活性剤；アカシアゴム、トラガントゴム、カラヤゴム、マルメロ、ペクチン、メチルセルロース、ヒドロキシメチルプロピルセルロース又はカルボキシメチルセルロースナトリウムのような粘液質；グリセリン、プロピレングリコール、ソルビトール、ジエチレングリコールモノエチルエーテル、クエン酸等の保湿剤；各種動植物の抽出物；ビタミン類；アミノ酸類；血行促進剤等の賦活剤；種々の酵素；消炎剤；糖類；着色料；殺菌剤又は保存剤；酸化防止剤；香料等を必要に応じて適宜配合することができる。

キシロビオースを配合した本発明の化粧料のヒト及び動物に対する安全性について、経皮急性毒性、皮膚刺激試験を行ったが全く皮膚に異常を認めなかった。

次に本発明で利用できるキシロビオースの製造を具体例によって説明する。

参考例（キシロビオースの製造）

原料としての植物由来のキシランをキシロビ

オース生成酵素により水溶液中で40℃、pH7.0の条件下で19時間糖化し、ろ過して得た糖化液を活性炭と濃硫酸とで60℃、pH2.0の条件下で2時間処理して、脱色、除タンパクした。得られた処理液に珪藻土を加え、フィルタープレスによりろ過し、次いでろ液を逆浸透圧濃縮し、濃縮糖化液を得た。濃縮糖化液を陽イオン交換樹脂、陰イオン交換樹脂、ついで混床樹脂で脱塩し、処理液に活性炭を加えて25℃、pH4～6.5の条件下で30分間処理して脱色し、得られた処理液に珪藻土を加えフィルタープレスによりろ過した。ろ液を60℃で4時間減圧濃縮し、キシロビオース組成物を得た。

このようにして得られたキシラン糖化物はキシロビオースが主成分であり、わずかにキシロースやキシロトリオース等が含まれていた。キシロビオースと共存する糖化物は保湿効果を損なうものではないが、キシロビオース含有量としては少なくとも20%以上が望ましい。又、逆浸透膜を用いることによって、必要に応じてキシロビオース濃度を高めることができる。

得られた前記のキシロビオース組成物を逆浸透膜で処理し、キシロビオース含有量95%以上とした。

以下、実験例及び実施例により、本発明を更に詳細に説明する。

実験例1：水分蒸発速度によるキシロビオースの保湿効果の測定（水溶液中での比較検討）

各種保湿剤を50%水溶液に調整し、高湿度下での吸湿性及び低湿度下での保水性を検討した。

被験物質：キシロビオース組成物
（キシロビオース95%以上含有）

比較保湿剤：ソルビトール

1,3-ブチレングリコール

プロピレングリコール

グリセリン

環境条件：＜条件A＞温度35℃、相対湿度95%
（リン酸一水素ナトリウムの飽和水溶液の入ったデシケータを35℃の恒温槽中に放置することにより、環境条件を設定した。）

＜条件B＞温度35℃、相対湿度40%
（塩化カルシウム溶液の入ったデシケータを35℃の恒温槽中に放置することにより、環境条件を設定した。）

測定方法：上記被験物質及び比較保湿剤をそれぞれ50%水溶液に調製し、各々2mgを上記環境条件下で放置し、24時間後、70時間後に秤量し、重量変化を調べた。

測定結果：①高湿度条件下（条件A）

高湿度条件下では、いずれの測定サンプルも吸水するが、70時間後の被験物質（キシロビオース）の重量変化率は+6.1%となり、グリセリン（+27.6%）、プロピレングリコール（+26.5%）、1,3-ブチレングリコール（+19.8%）、及びソルビトール（+10.9%）等の各種の保湿剤と比較すると高湿度下においてキシロビオースは吸湿しにくい性質

を保有する(表1)。

②低湿度条件下(条件B)

低湿度条件下では、いずれの測定サンプルも蒸発する。70時間後の被験物質(キシロピオース)の重量変化率は-42.2%となり、グリセリン(-39.9%)より保湿性は低いが、プロピレングリコール(-45.7%)、1,3-ブチレングリコール(-44.3%)、及びソルビトール(-42.5%)等と比較すると低湿度下での保湿性は高い性質を保有する(表2)。

表 2 相対湿度40%における重量変化(35℃)

試験物質	重量g, ()内は重量変化率%		
	0時間	24時間	70時間
キシロピオース組成物	2.00	1.31634(-34.18)	1.15121(-42.44)
ソルビトール	2.00	1.42623(-28.69)	1.14923(-42.54)
1,3-ブチレングリコール	2.00	1.49765(-25.12)	1.11389(-44.31)
プロピレングリコール	2.00	1.61146(-19.43)	1.08590(-45.71)
グリセリン	2.00	1.64412(-17.79)	1.20282(-39.86)

表 1 相対湿度95%における重量変化(35℃)

試験物質	重量g, ()内は重量変化率%		
	0時間	24時間	70時間
キシロピオース組成物	2.00	2.01486(0.743)	2.12140(6.07)
ソルビトール	2.00	2.06613(3.31)	2.21764(10.88)
1,3-ブチレングリコール	2.00	2.12273(6.14)	2.39539(19.77)
プロピレングリコール	2.00	2.18533(9.27)	2.53065(26.53)
グリセリン	2.00	2.19537(9.77)	2.55151(27.58)

考

察: 以上の結果を考察すると、夏等の高湿度条件下ではキシロピオースは吸湿性が低いためべとつき感が少なく、逆に低湿度条件下では保湿性が高いため皮膚からの水分の蒸散を防ぎ、化粧品の保湿剤としては理想的な性質を持っている。

実験例2: 水分蒸発速度による保湿効果の測定
(モイスチャークリームでの比較検討)

被験物質: キシロピオース組成物

(キシロピオース95%以上含有)

比較保湿剤: ソルビトール

1,3-ブチレングリコール

プロピレングリコール

グリセリン

環境条件: <条件A> 温度25℃, 相対湿度38%
(塩化カルシウム溶液の入ったデシケータを25℃の恒温槽中に放置することにより、環境条件を設定した。)
<条件B> 温度35℃, 相対湿度40%

(塩化カルシウム溶液の入ったデシケータを35℃の恒温槽中に放置することにより、環境条件を設定した。)

モイスチャークリーム：市販品

測定方法：モイスチャークリーム上に、上記被験物質及び上記比較保湿剤を各々5%ずつ添加し、上記環境下で放置し、24時間、48時間及び72時間後の重量を秤量し、0時間からの重量変化を観察した。

又、コントロールとして保湿剤を含まないO/Wクリームを用意した。

結果：①被験物質添加O/W系クリームと保湿剤無添加O/W系クリームの比較

被験物質添加O/W系クリームの72時間後の重量変化率は条件Aで-3.6%、条件Bで-16.8%であった。それと比較して保湿剤無添加O/W系クリームは条件Aで-13.1

%、条件Bで-31.8%となり、被験物質を添加することにより保湿性が高まる(表3、4)。

②被験物質と他の保湿剤との比較

条件Aにおいて72時間後の、被験物質添加O/W系クリームの重量変化率を調べると-3.6%となり、1,3-ブチレングリコール(-3.6%)、グリセリン(-3.8%)、プロピレングリコール(-3.9%)、及びソルビトール(-3.9%)等の結果と比較すると保湿性は高いレベルであった(表3)。又24時間後及び48時間後の結果も同様であった。

条件Bにおいて72時間後の、被験物質添加O/W系クリームの重量変化率を調べると-16.8%となり、1,3-ブチレングリコール(-16.9%)、グリセリン(-17.4%)、プロピレングリコール(-18.6%)、

及びソルビトール(-17.9%)等の結果と比較すると保湿性は高いレベルであった(表4)。

表 3

相対湿度38%、温度25℃における重量変化

試験物質	クリーム重量 g	全重量(容器+クリーム) g, ()内は重量変化率%			
		0時間	24時間	48時間	72時間
キシロビオース組成物	10.41	16.8051	16.5923(-2.04)	16.5121(-2.81)	16.4323(-3.58)
ソルビトール	10.04	16.4089	16.1593(-2.49)	16.0846(-3.23)	16.0146(-3.93)
1,3-ブチレングリコール	10.04	16.3207	16.0881(-2.32)	16.0193(-3.00)	15.9558(-3.63)
プロピレングリコール	9.96	16.3260	16.0824(-2.45)	16.0040(-3.23)	15.9430(-3.85)
グリセリン	10.60	16.9012	16.6313(-2.55)	16.5574(-3.24)	16.5020(-3.77)
コントロール(保湿剤なし)	7.10	11.1514	10.8811(-3.81)	10.4824(-9.42)	10.2237(-13.07)

表 4

相対湿度40%、温度35℃における重量変化

試験物質	クリーム重量 g	全重量(容器+クリーム) g, ()内は重量変化率%			
		0時間	24時間	48時間	72時間
キシロビオース組成物	10.24	16.6145	15.8604(-7.36)	15.3467(-12.38)	14.8967(-16.78)
ソルビトール	10.33	16.7210	16.0532(-6.46)	15.5193(-11.63)	14.8703(-17.92)
1,3-ブチレングリコール	10.24	16.4862	15.8411(-6.30)	15.3356(-11.24)	14.7528(-16.93)
プロピレングリコール	9.86	16.3127	15.5515(-7.72)	14.9856(-13.46)	14.4817(-18.57)
グリセリン	10.26	16.5508	15.8313(-7.01)	15.3524(-11.68)	14.7690(-17.37)
コントロール(保湿剤なし)	5.88	9.8746	8.9057(-16.48)	8.3494(-25.94)	8.0032(-31.83)

考 察：以上の結果を考察すると、キシロピオース添加のO/W系クリームは、他の保湿剤添加O/W系クリームと比較して、保湿性が同等以上であることが知られた。

尚、実験例2で試作した本発明によるキシロピオース含有のモイスチャークリームを実際に使用したところ、肌になじみが良く、清涼感があり、べとつきもなく官能的にも満足できるものであった。

以下、実施例により本発明の各種製品の処方及び製造法を説明する。

実施例1：ローション

以下の配合で、キシロピオース含有ローションを製造した。

品 目	配合量 (%)
油性成分：ステアリン酸	2.0
セタノール	1.5
ワセリン	3.0
ラノリンアルコール	2.0
流動パラフィン	10.0
乳 化 剤：ポリオキシエチレンモノ オレイン酸エステル	2.0
香 料	0.5
防腐剤・酸化防止剤	適 量
保 湿 剤：キシロピオース組成物 (キシロピオース含有量95%以上)	8.0
アルカリ：トリエタノールアミン	1.0
精 製 水	70.0

実施例3：栄養クリーム

以下の配合で、キシロピオース含有栄養クリームを製造した。

尚、本製品を実際に用いたところ、肌なじみが

品 目	配合量 (%)
キシロピオース組成物 (キシロピオース95%以上含有)	1.0
プロピレングリコール	1.0
クエン酸	0.2
95%エタノール	10.0
香 料	適 量
P O E ラウリルエーテル	0.5
蒸 留 水	残 余

尚、本製品を実際に用いたところ、肌なじみがよく、清涼感があり、べとつきがなく官能的にも満足できるものであった。

実施例2：乳 液

以下の配合で、キシロピオース含有乳液を製造した。

尚、本製品を実際に用いたところ、肌なじみがよく、清涼感があり、べとつきがなく官能的にも満足できるものであった。

よく、清涼感があり、べとつきがなく官能的にも満足できるものであった。

品 目	配合量 (%)
ステアリン酸	2.0
ステアリルアルコール	7.0
還元ラノリン	2.0
スクワラン	5.0
オクチルドデカノール	6.0
P O E (25) セチルエーテル	3.0
グリセリンモノステアレート	2.0
防 腐 剤	適 量
香 料	適 量
プロピレングリコール	5.0
キシロピオース組成物 (キシロピオース含有量95%以上)	1.0
蒸 留 水	残 余

実施例4：バック

以下の配合で、キシロビオース含有バックを製造した。

尚、本製品を実際に用いたところ、肌なじみがよく、清涼感があり、べたつきがなく官能的にも満足できるものであった。

品 目	配合量 (%)
皮膚剤：ポリビニルアルコール	15.0
増粘剤：カルボキシメチルセルロース ナトリウム	5.0
保湿剤：キシロビオース組成物 (キシロビオース含有量95%以上)	3.0
エタノール	10.0
香料	0.5
防腐剤、酸化剤	適量
精製水	66.5

実施例5：リップトリートメント

以下の配合で、キシロビオース含有リップトリートメントを製造した。

尚、本製品を実際に用いたところ、肌なじみがよく、清涼感があり、べたつきがなく官能的にも満足できるものであった。

品 目	配合量 (%)
キャンデリラロウ	9.0
固形パラフィン	8.0
ミツロウ	5.0
カルナバロウ	5.0
ラノリン	11.0
ヒマシ油	残余
キシロビオース組成物 (キシロビオース含有量95%以上)	0.1
イソプロピルミリスレート	10.0
香料	適量
酸化防止剤	適量

実施例6：軟膏

以下の配合で、キシロビオース含有軟膏を製造した。

尚、本製品を実際に用いたところ、肌なじみがよく、満足できるものであった。

品 目	配合量 (%)
ステアリルアルコール	18.0
モクロウ	20.0
キシロビオース組成物 (キシロビオース含有量95%以上)	0.5
モノオレイン酸エチルエステル	0.5
ワセリン	40.0
精製水	残余

きるものであった。

品 目	配合量 (%)
ヒドロキシメチルプロピル セルロース	0.2
水	56.0
アミソフトCT-12 (30%)	29.0
アミゾールCDE	4.5
食塩	0.4
キシロビオース組成物 (キシロビオース含有量95%以上)	8.9
ポリエチレングリコール モノステアレート	1.0

発明の効果

キシロビオースを配合した本発明の皮膚外用剤はべたつき、変色、異臭の発生がなく、保湿効果及び肌荒れ改善効果に優れている。

実施例7：ヘアシャンプー

以下の配合で、キシロビオース含有ヘアシャンプーを製造した。

尚、本製品を実際に用いたところ、皮膚及び毛髪にしっかりと感をもたらされ、官能的にも満足で

第1頁の続き

⑤Int. Cl.⁵A 61 K 31/70
// C 07 H 3/04

識別記号


ADA

庁内整理番号

9164-4C

7822-4C

手 続 補 正 書

平成 3 年 6 月 27 日 

特許庁長官 深 沢 亘 殿

1. 事件の表示

平成 2 年特許願第142845号

2. 発明の名称

皮膚外用剤

3. 補正をする者


事件との関係 特許出願人
住 所

名 称 (190) サントリー株式会社

4. 代 理 人

住 所 東京都千代田区大手町二丁目2番1号
新大手町ビル 206区

電 話 3270-6641~6

氏 名 (2770) 弁理士 湯 浅 恭 三 

5. 補正の対象

方 式
審 査

特許

明細書の〔発明の詳細な説明〕の欄

3.624

6. 補正の内容

(1) 明細書第5頁第13行と第14行との間に
次の記載を挿入する。『キシロビオース生成酵素としては市販のものを
使用でき、例えばアスペルギルス・ニガー

(Aspergillus niger)、トリコデルマ・ビリデ

(Trichoderma viride)、フミコーラ・ラヌギノ

サ (Humicola lanuginosa)、ケトミウム・グラシ

ル (Chaetomium gracile)、バシルス・プミラス

(Bacillus Pumilus) 起源のものを使用できる。』

(2) 明細書第10頁第6行の「2mg」を

「2g」に訂正する。

(3) 明細書第11頁の「-42.2%」を

「-42.4%」に訂正する。

以 上